

МАЛОНДИТИОАМИДЫ В СИНТЕЗ ПРОИЗВОДНЫХ 1,2-ДИТИОЛА

Климарева Е.Л., Обыденнов К.Л., Головкин Н.А., Смирнов А.И., Костерина М.Ф., Моржерин Ю.Ю.

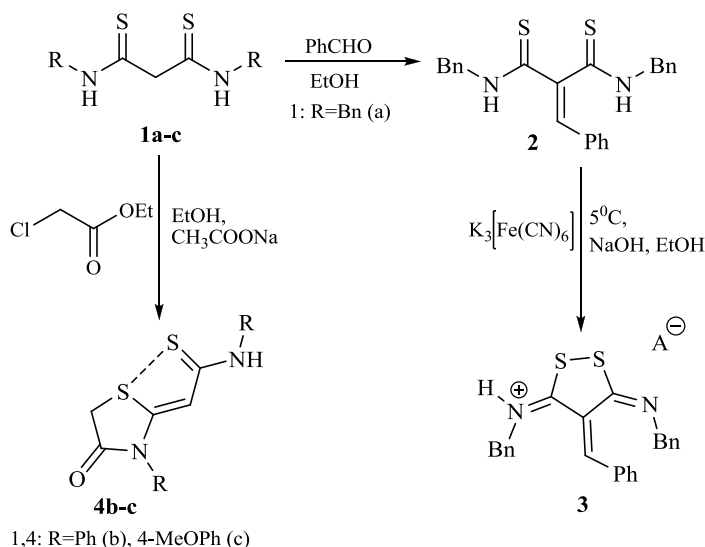
ФГАОУ ВПО "УрФУ имени первого Президента России Б. Н. Ельцина",

620002 Екатеринбург, ул. Мира, 19.

Дитиомалонамиды являются перспективными билдинг-блоками в органическом синтезе благодаря наличию в их структуре тиоамидной группы и активного метиленового фрагмента, что благоприятствует получению 1,2-дитиольных систем, проявляющих противоопухолевую¹, противораковую², антидиабетическую³ активности.

Так N,N'-дибензилдитиомалонамид **1a** вступает в конденсацию Кневенагеля с бензальдегидом с образованием продукта **2** с выходом близким к количественному. Окислением полученного N,N'-дибензилпропанбис(тиоамида) красной кровяной солью была получена соль 1,2-дитиолана **3**.

Дитиомалонамиды **1b-c** взаимодействуют в спирте с хлоруксусным эфиром в присутствии основания (ацетата натрия) с образованием тиазолидинов **4b-c** по реакции Ганча. Полученные тиазолы интересны тем, что содержат экзоциклические тризамещенные двойные связи. Взаимодействие тиокарбонильной группы с циклическим атомом серы делает такие соединения аналогами 1,2-дитиолов. В спектрах ЯМР ¹H тиазолов **4b-c** мы наблюдали только один набор сигналов, что свидетельствует об отсутствии изомерии.



Таким образом, нами было показано, что дитиомалонамиды являются удобными предшественниками для получения производных 1,2-дитиола.

1. C. W. Rees and D. J. Williams, J. Org. Chem., 1996, 61, p. 9178
2. Y. Y. Maxuitenko, A. H. Libby, H. H. Joyner, T. J. Curphey, D. L. MacMillan, T.W. Kensier and B. D. Roebuck, Carcinogenesis, 1998, 19, p. 1609.
3. D. Edmont, R. Rocher, C. Plisson and J. Chenault, Bioorg. Med. Chem. Lett., 2000, 10, p. 1831–1834.